

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2001 年 5 月 3 日 (03.05.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/30757 A1

(51) 国際特許分類: C07D 213/30,
277/26, 277/28, 277/32, 277/44, 215/14, 215/56, 307/52,
513/04, 263/56, 417/04, 417/06, 417/12, 417/14, 285/08,
498/06, 471/04, 237/28, 409/12, A61K 31/426, 31/427,
31/47, 31/341, 31/437, 31/423, 31/44, 31/433, 31/4439,
31/4709, 31/4738, 31/4375, 31/502, 31/5383, A61P 31/04,
G01N 33/15, 33/50

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/07563

(22) 国際出願日: 2000 年 10 月 27 日 (27.10.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
09/428,466 1999 年 10 月 28 日 (28.10.1999) US
特願平 2000-326713
2000 年 10 月 26 日 (26.10.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): マイ
クロサイドファーマシューティカルズ インコー
ポレイテッド (MICROCIDE PHARMACEUTICALS,
INC.) [US/US]; 94043 カリフォルニア州 マウンテン
ビュー モード アベニュー 850 California (US). 第一
製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒103-8234 東京都中央区日本橋 3 丁目
14 番 10 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): リーガー ロジャー
(LEGER, Roger) [CA/CA]; J4R 2V8 ケベック州 セン

ト-ランバート アッパー エディソン 202 Quebec (CA).
ワトキンス ウィリアム ジョン (WATKINS, William
John) [US/US]; 94087 カリフォルニア州 サニエヴィ
ル オネイダ ドライブ 626 California (US). ツァン ジェ
イソン チジア (ZHANG, Jason Zhijia) [US/US]; 94404
カリフォルニア州 フォスター シティ クレイン アベ
ニュー 770 California (US). レナウ トーマス エリック
(RENAU, Thomas Eric) [US/US]; 95051 カリフォルニ
ア州 サンタクララ ベッパリー ツリー レイン #224 900
California (US). リーヴィング ジャック (LEE, Ving
Jack) [US/US]; 94024 カリフォルニア州 ロスアルトス
カーボコート 1335 California (US). 太田 敏晴 (OHTA,
Toshiharu) [JP/JP]. 中山 清 (NAKAYAMA, Kiyoshi)
[JP/JP]. 石田 洋平 (ISHIDA, Yohhei) [JP/JP]. 大塚 雅己
(OHTSUKA, Masami) [JP/JP]. 川戸 晴子 (KAWATO,
Haruko) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江戸川区北葛西
1 丁目 16 番 13 号 第一製薬株式会社 東京研究開発セン
ター内 Tokyo (JP).

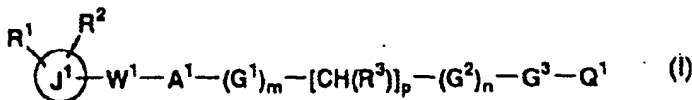
(74) 代理人: 今村 正純, 外 (IMAMURA, Masazumi et al.)
; 〒104-0031 東京都中央区京橋一丁目 5 番 5 号 KRF ビ
ル 5 階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL,
IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV,
MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT,
RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM,
[続票有])

(54) Title: DRUG DISCHARGE PUMP INHIBITORS

(54) 発明の名称: 薬剤排出ポンプ阻害薬



(57) Abstract: Drugs for preventing and/or treating microbial infectious diseases which contain, as the active ingredient, compounds represented by the formula (I), physiologically acceptable salts thereof or hydrates of the same and have an effect of making a microorganism having acquired tolerance to a drug non-tolerant. In said formula R¹ and R² independently represent each hydrogen, halogeno, carboxy, etc.; J¹ represents 5- or 6-membered heteroaryl; W¹ represents -CH=CH-, -CH≡CH-, -CH₂CH₂-, etc.; A¹ represents phenylene, pyridinedyl, furandyl, etc.; G¹ represents oxygen, carbonyl, ethynyl, etc.; p is an integer of from 0 to 3; G² represents phenylene, furandyl, tetrahydrofurandyl, etc.; G³ represents -CH₂- or a single bond; m and n represent each an integer of 0 or 1; and Q¹ represents an acidic group.

[続票有]



AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

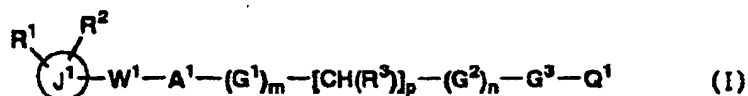
2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:

下記の一般式 (I):



〔式中、 R^1 及び R^2 はそれぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、カルボキシル基などを示し； J^1 は5員又は6員の芳香族ヘテロ環を示し； W^1 は $-CH=CH-$ 、 $-CH\equiv CH-$ 、 $-CH_2CH_2-$ などを示し； A^1 はフェニレン基、ピリジンジイル基、フランジイル基などを示し； G^1 は酸素原子、カルボニル基、エチニル基などを示し、 p は0から3の整数を示し； G^2 はフェニレン基、フランジイル基、テトラヒドロフランジイル基などを示し； G^3 は $-CH_2-$ 又は単結合を示し； m 及び n は0又は1の整数を示し；及び Q^1 は酸性基を示す〕で表される化合物、生理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物を有効成分として含み、薬剤耐性を獲得した微生物を脱耐性化させる作用を有する微生物感染症の予防及び／又は治療のための医薬。